

⑬ 日本国特許庁(JP)

⑩ 特許出願公開

⑨ 公開特許公報(A)

昭61-161219

⑪ Int. Cl.<sup>4</sup>A 61 K 35/78  
7/00

識別記号

ADA  
ABE

庁内整理番号

7138-4C  
7306-4C

⑭ 公開 昭和61年(1986)7月21日

審査請求 未請求 発明の数 1 (全4頁)

⑮ 発明の名称 アトピー性皮膚炎症用化粧料組成物

⑯ 特 願 昭60-1222

⑰ 出 願 昭60(1985)1月8日

⑱ 発 明 者 有 地 滋 豊中市寺内2丁目6番1号1002

⑲ 発 明 者 木 村 善 行 豊中市東寺内町173番606号 株式会社大阪薬品研究所内

⑳ 出 願 人 株式会社 大阪薬品研 豊中市東寺内町173番606号  
究 所

㉑ 代 理 人 弁理士 清原 義博

## 明 細 書

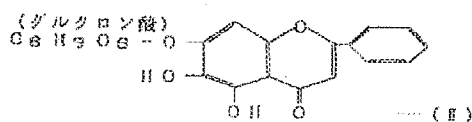
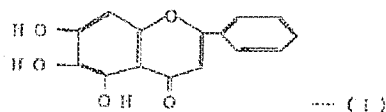
## 1. 発明の名称

アトピー性皮膚炎症用化粧料組成物

## 2. 特許請求の範囲

Ⅲ コガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)及びこの近縁種の乾燥粉末及び／又はこのコガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)から抽出された抽出物を必須成分としてなるアトピー性皮膚炎症用化粧料組成物。

Ⅳ 前記コガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)及びこの近縁種の乾燥粉末及び／又はこのコガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)から抽出された抽出物が次式(Ⅰ)及び／又は次式(Ⅱ)であることを特徴とするアトピー性皮膚炎症用化粧料組成物。



## 3. 発明の詳細な説明

(産業上の利用分野)

この発明はアトピー性皮膚炎症用化粧料組成物に関し、より詳しくはこの発明の目的はシソ科(Shiisakae)のコガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)及びこの近縁種の乾燥粉末及び／又はこのコガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)から抽出された抽出物を必須成分としてなるアトピー性皮膚炎症用化粧料組成物の提供にある。

(発明の背景)

一般に、アレルギー反応とは、生体内で抗原抗体反応が起こるとその結果生体の化学伝達物質であるヒスタミン、アセチルコリン、ブラディキニン、SRS-Aなどが遊離されこれが組織を障害して起こる生体反応であると解されている。

このアレルギー反応の一種であるアトピー症とは、人間に特有な、一定の物質に対する先天的過敏症のことを言い、本人及び家族に気管支喘息、枯草熱、アレルギー性鼻炎として発現し、この遺伝は遺伝し、この家系の人は食物や吸収される抗

原に対し高度の過敏症を呈しやすいことなどの特徴があると言われている。

アトピー性皮膚炎とは、このような素因の上に住じる皮膚炎症であって、その自覚的な症状としては著明な痒痒感があり、掻癢によって皮疹は増悪し慢性化すると言われている。またこのようなアトピー性皮膚炎の痒痒感は発作的に出現することが多く、かつ僅かな刺激によって誘発、増強される傾向があると言われている。

アトピー性皮膚炎はアレルギー反応の一様態であるので、その消炎のためには前記アレルギー反応の原因の一つであるSRS-Aの前駆物質である5-HETEの産出を阻害すればよく、この5-HETEはアラキドン酸のリボキシゲナーゼ代謝物の一つであるゆえ5-HETEを特異的(選択的)に阻害するものは抗アレルギー効果特にアトピー性皮膚炎の治療剤としての用途が極めて高いと考えられている。

(従来技術及びその欠点)

従来のこのようなアトピー性皮膚炎に対する

治療法は、全身療法として抗ヒスタミン剤の内服、また、ヒスタミン加免疫グロブリン製剤、強力ミノラーゲンC、ノイロトロピン特号などの皮下注射が挙げられる。

しかし、これらはいずれも医薬品であるため処方及び治療にあたって医師の診断と指示を仰がなければならない。特に皮下注射は効果が大きいとされるが反面大きな痛みを伴うので乳幼児には適さないという欠点があった。

また、局所療法としてワセリン基剤の副腎皮質ホルモン軟膏などがあるが、乳剤性軟膏基剤は適応範囲が狭く、ときには急性増悪をきたすこともあり、また副腎皮質ホルモン軟膏はその経皮吸収による内分泌系への悪影響があり、とくに乳幼児ではその影響が大きいという欠点があった。

(発明の経過)

そこでこの発明者は、上記従来の欠点を悉く解消するため前記したリボキシゲナーゼの特異的(選択的)な阻害剤の発見につとめたところ、従来は消炎、解熱剤としてしか知られていなかったコ

ガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)及びこの近縁種に関し鋭意研究したところ、何と驚くべきことにこのコガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)及びこの近縁種の乾燥粉末及び/又はこのコガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)から抽出された抽出物がリボキシゲナーゼを特異的(選択的)に阻害し即ち5-HETEの産出を阻害することを見いだした。

その結果このコガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)及びこの近縁種の乾燥粉末及び/又はこのコガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)から抽出された抽出物を必須成分としてなる化粧料組成物を調製すればこの化粧料組成物がアトピー性皮膚炎の治療に大きな効果があることを見いだしたこの発明に至った。

(解決手段)

即ちこの発明はコガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)及びこの近縁種の乾燥粉末及び/又はこのコガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)から抽出された抽出物を必須成分としてな

るアトピー性皮膚炎用化粧料組成物に係るものである。

(発明の構成)

この発明で使用するコガネバナとはシソ科(Labiatae)に属する多年草で学名をスカテラリア バイカレンシス ゲオルギ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)といい、原産は中国大陸に広く分布し朝鮮半島にまでおよぶものである。

この発明においては、このようなコガネバナ(*Scutellaria baicalensis* GEORGI)の同属のスカテラリア ヴィスシデムラ ブクスゲ(*Scutellaria viscidula* BUXGE)、スカテラリア レーデリアナ ディールス(*Scutellaria rahdariana* DIELS)、スカテラリア アモエナ ヴィグерт(*Scutellaria amoena* WIGHT)などの近縁種もまた好適に使用することができ、これらの全部位(地上部または地下部、あるいは種子)特に根を原材料として好適に使用できる。

この発明において、コガネバナの乾燥粉末を得るには、まずコガネバナを公知の天然乾燥、熱風

乾燥、あるいは凍結乾燥のいずれかの手段で乾燥させ、該コガネバナ乾燥物を公知の機械粉碎（ボールミル・スクリー）によって粉末化する。この発明においてはこの粉末も必須配合成分として有効に利用できる。

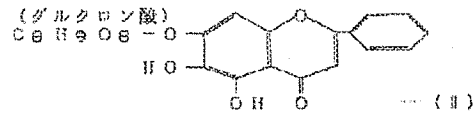
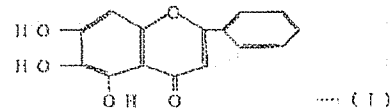
次いで上記コガネバナ乾燥粉末からその抽出物を以下のようにして得る。

まず、非乾燥コガネバナを細切りし、この細切り物又は前記乾燥粉末を水またはメタノールで50℃、1～2hr加熱下で抽出し、濾過し、濾液を濃縮し、更に減圧濃縮して乾固する。この発明においてはこの濃縮液の段階でも必須配合成分として利用できるし、又乾固物の段階でも配合成分とすることができる。

更に前記乾固物をメタノールに溶解すると沈澱物と溶解物に、この乾固物が分かれる。この沈澱物（I）をデカンテーションで取り出すとともに、メタノール溶液に塩化カルシウムを加え、これに室温で酸を加えて脱塩操作を行ない、濃縮しこの濃縮物を使用するか又は更に減圧濃縮して沈澱物

（II）を得、配合成分とすることができる。

この沈澱物（I）がバイカレイン（baicalin）（次式I）で、沈澱物（II）がバイカリン（baicalin）（次式II）である。



コガネバナの乾燥粉末及び／又は以上のようにして得られたそれぞれの段階のコガネバナの抽出物を使用してこの発明に係るアトピー性皮膚炎療用化粧品組成物とするには、通常被用者が一日に20mg乃至1000mg程度のコガネバナ乾燥粉末及び／又はコガネバナ抽出物を被用できる様な任意の化粧品組成物形態とすればよい。

その形態例を具体的に開示すると、軟膏、石鹸

化粧水、クリーム等が挙げられる。

#### （発明の効果）

以上の如くこの発明に係るコガネバナ（*Scutellaria baicalensis* GEORGI）及びこの近縁種の乾燥粉末及び／又はこのコガネバナ（*Scutellaria baicalensis* GEORGI）から抽出された抽出物を必須成分としてなるアトピー性皮膚炎療用化粧品組成物は、軟膏、石鹸、化粧水、クリーム等の任意の化粧品組成物として被用すれば、医薬品でないので、治療にあたって医師の診断と指示を仰ぐ必要がなく、家庭で手軽に施用できるという効果を奏す。

また、軟膏、石鹸、化粧水、クリーム等の形態であるので皮下注射のような大きな痛みを伴わない故、乳幼児には特に適するという効果を奏す。

更に、該化粧品組成物の配合組成中に含まれている成分は植物抽出成分であるので、副腎皮質ホルモン軟膏のようにその経皮吸収による内分泌系への悪影響などの副作用が殆どないという効果を奏す。

以下この発明に係るアトピー性皮膚炎療用化粧

料組成物の試験例を記載することにより、この発明の効果をより一層明確なものとする。

#### （試験例）

ウィスター系ラットを使用し、このラット腹腔内多核白血球をH.E.P.S.-生食緩衝液（pH 7.4）で洗浄し、同緩衝液に懸濁、超音波処理を行なったものをアラキドン酸代謝の酵素液として用いた。この血小板ホモジネイトとバイカレイン（baicalin）及びバイカリン（baicalin）の次々にそれぞれ示す種々の濃度のサンプルとを37℃、5分間保温し、その後（1℃）アラキドン酸（0.05μCi）を加え5分間インキュベートする。反応をギ酸で止め（pH 3）アラキドン酸代謝産物を酢酸エチルで抽出し、シリカゲル薄層クロマトグラフィー（TLC）で分離して定置した（展開液：石油エーテル：エーテル：酢酸＝50：50：1、V/V、TLCはメルク574B）。放射活性物質はオートラジオグラフィで検出し、そのスポットを剪取り、放射活性を液体シンチレーションカウンターで定置した。

尚、次表に示す12-ハイドロキシヘプタデカトリエン酸(HHT)はシクロオキシゲナーゼにより代謝される5-ハイドロキシエイコサテトラエン酸(5-HETE)である。HHTは既知のHHTとの比較により同定した。5-HETEはGC-MSにより同定した。

以下、試験結果を第1乃至第2表にまとめて示す。

第 1 表

		生成物 (比較例との割合%)	
		HHT	5-HETE
* バイカレイン	**	100.0 ± 0.0	100.0 ± 0.0
	- 7	94.0 ± 0.0	94.0 ± 0.0
	- 6	99.0 ± 0.0	65.0 ± 4.0
	- 5	93.8 ± 2.7	49.0 ± 0.0
	- 4	38.0 ± 9.0	37.5 ± 4.5
	- 3	19.0 ± 4.0	22.0 ± 4.0

\* バイカレインの単位は1モル×10の露指数  
\*\* 濃度の比較例

第 2 表

		生成物 (比較例との割合%)	
		HHT	5-HETE
* バイカリン	**	100.0 ± 0.0	100.0 ± 0.0
	- 7	95.5 ± 2.5	81.8 ± 4.7
	- 6	91.5 ± 5.0	71.0 ± 1.5
	- 5	92.8 ± 12.3	53.5 ± 5.0
	- 4	22.8 ± 4.8	44.0 ± 6.0
	- 3	19.5 ± 3.0	35.0 ± 5.0

\* バイカリンの単位は1モル×10の露指数  
\*\* 濃度の比較例

以上の結果明らかな如く、この発明で使用するバイカレイン(balcaletin)及び/又はバイカリン(balcalin)は5-HETEの産出を阻害するものとして優れた効果を奏し、即ちバイカレイン(balcaletin)及び/又はバイカリン(balcalin)を必須成分としてなる化粧品組成物はアレルギー反応の一様態であるアトピー性皮膚炎の治療に優れた効果を奏することがわかる。

代理人 弁護士 清 原 義 博



## PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 61-161219

(43)Date of publication of application : 21.07.1986

(51)Int.Cl.

A61K 35/78

A61K 7/00

(21)Application number : 60-001222

(71)Applicant : OSAKA CHEM LAB

(22)Date of filing : 08.01.1985

(72)Inventor : YUCHI SHIGERU  
KIMURA YOSHIYUKI

## (54) SKIN COMPOSITION FOR ATOPIC DERMATITIS

## (57)Abstract:

PURPOSE: The titled composition effective for atopic dermatitis, inhibiting specifically lipoxxygenase and production of 5-HETE, comprising dried powder of 'KOGANEBAKA' (*Scutellaria baicalensis* GEORGI) of the family Labiatae or its relative species, or an extract of the powder as an essential component.

CONSTITUTION: A composition comprising baicalein shown by the formula I or baicalein shown by the formula II of dried powder of 'KOGANEBAKA' (*Scutellaria baicalensis* GEORGI) or its relative species (e.g., *Scutellaria viscidula* BUXGE, etc.) or an extract of the powder as an active ingredient. This composition can be used any cosmetic composition (e.g., ointment, soap, toilet lotion, cream, etc.), and easily applied at home without indication of doctor. It has no side effect like adrenocortical hormone ointment, inhibits production of 5-HETE, and has improved remedying effect on atopic dermatitis, one form of allergic reactions.

